

**1,1,2-triphenylbut-1-ene derivatives**

Patent Number: ☐ US5047431  
Publication date: 1991-09-10  
Inventor(s): SCHICKANEDER HELMUT (DE); LOESER ROLAND (DE); GRILL HELMUT (DE)  
Applicant(s): KLINGE CO CHEM PHARM FAB (DE)  
Requested Patent: ☐ EP0054168, B1  
Application Number: US19900523266 19900514  
Priority Number(s): DE19803046719 19801211  
IPC Classification: A61K31/135; C07C217/20  
EC Classification: C07C45/46, C07C45/67C, C07C45/68, C07C49/84, C07D309/12  
Equivalents: ☐ DE3046719, ☐ IE51882, JP1320416C, JP57122049, JP60039347B, MX9203724

**Abstract**

Novel (E)-1-[4'-(2-alkylaminoethoxy)phenyl]-1- (3'-hydroxyphenyl)-2-phenylbut-1-enes of the general formula



wherein R1 and R2 may be the same or different, provided that, when R1 and R2 are the same, each of them is a methyl or ethyl radical, and when R1 and R2 are different, one of them is hydrogen and the other is a methyl or ethyl radical, and the therapeutically compatible salts thereof, have a marked anti-estrogenic effect and are suitable for treating hormone-dependent mammary tumors. The compounds can



be prepared by dehydrating carbinols of the general formula wherein R1 and R2 may be the same or different, provided that, when R1 and R2 are the same, each of them is a methyl or ethyl radical, and when R1 and R2 are different, one of them is a benzyl radical and the other is a methyl or ethyl radical; and wherein R3 is hydrogen or an easily hydrolyzable protecting group, through the action of mineral acid while removing any protecting group present, isolating through crystallization the E-form from the pair of isomers obtained, and removing by hydrogenolysis any benzyl group present. Compositions comprising the subject 1,1,2-triphenylbut-1-ene derivatives are described also. The corresponding novel 1,1,2-triphenylbut-1-ene derivatives having the (Z) configuration are also disclosed.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

①9



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets

①1

Veröffentlichungsnummer: **0 054 168**  
**B1**

①2

## EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

④5

Veröffentlichungstag der Patentschrift:  
**11.07.84**

⑤1

Int. Cl.<sup>3</sup>: **C 07 C 93/06, A 61 K 31/135**

②1

Anmeldenummer: **81109254.3**

②2

Anmeldetag: **29.10.81**

⑤4

**1,1,2-Triphenyl-but-1-en-Derivate sowie Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Arzneimittel.**

③0

Priorität: **11.12.80 DE 3046719**

④3

Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
**23.06.82 Patentblatt 82/25**

④5

Bekanntmachung des Hinweises auf die Patenterteilung:  
**11.07.84 Patentblatt 84/28**

⑧4

Benannte Vertragsstaaten:  
**AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE**

⑤6

Entgegenhaltungen:  
**DE - A - 1 493 282**

⑦3

Patentinhaber: **Klinge Pharma GmbH,  
Berg-am-Laim-Strasse 129, D-8000 München 80 (DE)**

⑦2

Erfinder: **Schickaneder, Helmut, Dr., Anzinger  
Strasse 22, D-8011 Poing (DE)**  
Erfinder: **Löser, Roland, Dr., Fichtenweg 12,  
D-8133 Feldafing (DE)**  
Erfinder: **Grill, Helmut, Dr., Zugspitzstrasse 148,  
D-8011 Vaterstetten (DE)**

⑦4

Vertreter: **Wuesthoff, Franz, Dr.-Ing. et al, Patentanwälte  
Wuesthoff -v. Pechmann-Behrens-Goetz  
Schweigerstrasse 2, D-8000 München 90 (DE)**

**EP 0 054 168 B1**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents im Europäischen Patentblatt kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).